

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 4 月 7 日 (07.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/030752 A1(51) 国際特許分類:
215/56, A61K 31/4709, A61P 31/04

C07D 401/04,

(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE
PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT
OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町
1 丁目 3 番 6 号共同ビル Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/014262

(22) 国際出願日: 2004 年 9 月 29 日 (29.09.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

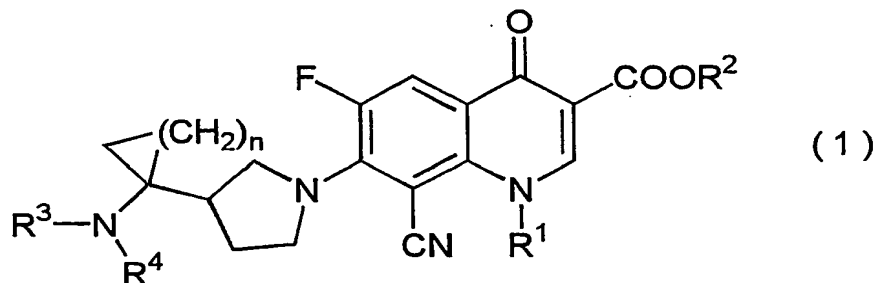
(30) 優先権データ:
特願2003-336864 2003 年 9 月 29 日 (29.09.2003) JP(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一
製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒1038234 東京都中央区日本橋 3 丁目
1 4 番 1 0 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 高橋 寿 (TAKA-
HASHI, Hisashi) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区
北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究
開発センター内 Tokyo (JP). 宮内 理恵 (MIYAUCHI,
Rie) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目
1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター
内 Tokyo (JP). 竹村 真 (TAKEMURA, Makoto) [JP/JP];
〒1348630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第
一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP).(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 8-CYANOQUINOLONECARBOXYLIC ACID DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 8-シアノキノロンカルボン酸誘導体

(57) Abstract: A quinoline antibacterial which has potent antibacterial activity against gram-positive bacteria and gram-negative bacteria and is highly safe; and a therapeutic agent for infectious diseases. Provided is a compound represented by the following formula (1): (Chemical formula 1) (wherein R¹ represents optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl, etc.; R² represents hydrogen, etc.; R³ and R⁴ each independently represents hydrogen, C₁₋₆ alkyl, or substituted carboxy derived from an amino acid, dipeptide, or tripeptide, provided that when R³ and R⁴ are C₁₋₆ alkyl, then the alkyls each may be substituted by one or more atoms or groups selected among hydroxy, halogeno, C₁₋₆ alkylthio, and C₁₋₆ alkoxy; and n is an integer of 1 to 3), a salt of the compound, or a hydrate of either.

[続葉有]

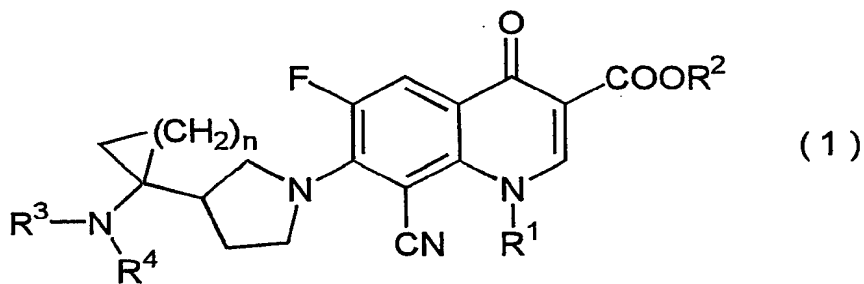


(57) 要約:

グラム陽性菌及びグラム陰性菌に対して強力な抗菌活性を示し、高い安全性を有するキノロン系抗菌薬及び感染症治療薬を提供する。

下記式(1):

【化1】



(式中、 R^1 は、置換基を有していてもよい炭素数3～6の環状アルキル基等を示し、 R^2 は、水素原子等を示し、 R^3 及び R^4 は、各々独立に、水素原子もしくは炭素数1～6のアルキル基を示すか、又はアミノ酸、ジペプチド又はトリペプチド由来の置換カルボキシル基を示すが、 R^3 及び R^4 が炭素数1～6のアルキル基の場合、当該アルキル基は、水酸基、ハロゲン原子、炭素数1～6のアルキルチオ基及び炭素数1～6のアルコキシ基より選ばれる1又は2以上の原子又は基によって置換されていてもよい。 n は、1～3の整数を示す。)

で表わされる化合物、その塩又はそれらの水和物、抗菌薬及び感染症治療薬。